

СИНТЕЗ 1-[2-(АДАМАНТИЛ-1)-ЭТИЛ-1]-R-ФЕНИЛ-1,2,3,6- ТЕТРАГИДРОПИРИДИНОВ

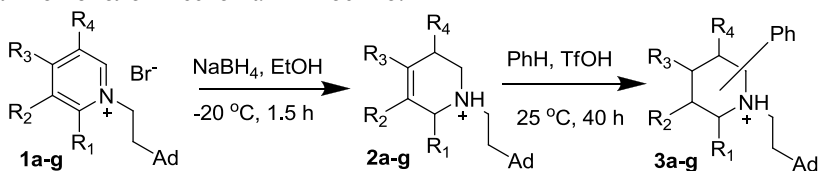
Шадрикова В.А., Ростова М.Ю., Костылева И.Б., Климошкин Ю.Н.

Самарский государственный технический университет

443100, г. Самара, ул. Молодогвардейская, д. 244

Тетрагидропиридиновые и пиперидиновые фрагменты являются неотъемлемыми компонентами множества лекарственных препаратов и биологических активных веществ. Арилзамещенные пиперидины и тетрагидропиридины входят в состав многих препаратов, применяющихся для терапии неврологических заболеваний и психических расстройств.

В продолжение исследования синтеза и химических свойств адамантилированных производных пиридина [1] нами проведено превращение бромидов 1-[2-(адамантил-1)-этил-1]пиридиния в соответствующие 1,2,3,6-тетрагидропиридины с целью получения фенилзамещенных 1-[2-(адамантил-1)-этил-1]пиперидиновых систем – веществ с потенциальной биологической активностью.



Ad = Адамант-1-ил

В результате действия борогидрида натрия на четвертичные соли **1a-к** в этаноле при -20°C образуются соответствующие 1-[2-(адамантил-1)-этил-1]1,2,3,6-тетрагидропиридины **2a-к** с хорошими выходами.

Известно, что 1,2,3,6-тетрагидропиридины в среде трифторметан-сульфокислоты (TfOH) способны участвовать в реакциях S_EAr с бензолом и его производными, содержащими электронодонорный заместитель [2]. 1,2,3,6-тетрагидропиридины **2a-з** введены в реакцию алкилирования бензола по Фриделю-Крафтсу, при этом наблюдается образование фенилзамещенных 1-[2-(адамантил-1)-этил-1]пиперидинов **3a-з** с выходами 70-85%. Реакцию проводили в избытке TfOH при комнатной температуре в течение 40 часов, контроль за ходом реакции осуществляли методом ТСХ (элюент CHCl₃–MeOH, 3:1).

Строение полученных соединений подтверждено набором данных, ИК-, ЯМР ¹H и ¹³C спектроскопии и хроматомасс-спектрометрии.

1. Shadrikova V.A., Golovin E.V., Klimochkin Yu.N. // Chem. of Heterocycl. Compound. 2015. V. 50. P. 1586.

2. Klumpp D.A., Beauchamp P.S., Sanchez G.V.Jr. et al. // Tetrahedron Lett. 2001. V. 42. P. 5821.

Работа выполнена с использованием научного оборудования Центра коллективного пользования СамГТУ "Исследование физико-химических свойств веществ и материалов"

ОРГАНОКАТАЛИТИЧЕСКИЕ МЕТОДЫ ФОСФОРИЛИРОВАНИЯ НЕПРЕДЕЛЬНЫХ ЭЛЕКТРОФИЛЬНЫХ СОЕДИНЕНИЙ С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ ТРЕТИЧНЫХ ФОСФИНОВ

Шамсутдинова Ф.Г., Ильин А.В., Фатхутдинов А.Р., Салин А.В.

Казанский федеральный университет
420008, г. Казань, ул. Кремлевская, д. 18

Третичные фосфины в настоящее время находят все большее применение в органокатализе. В данной работе изучено фосфин-катализируемое присоединение гидрофосфорильных соединений по кратным связям активированных алкенов и алкинов. Продуктами данной реакции являются соединения с новой связью фосфор-углерод, представляющие интерес для промышленности и медицины.

В настоящей работе были изучены реакции диалкилфосфитов и фосфонитов с различными активированными алкенами, катализируемые третичными фосфинами. Показано, что каталитическая активность третичных фосфинов значительно превышает таковую для нуклеофильных третичных аминов, таких как DABCO и DBU. В ацетонитриле в присутствии трибутилфосфина данные реакции протекают при комнатной температуре и приводят к продуктам присоединения с высокими выходами. Оптимизированы условия проведения реакций, изучено влияние заместителей при атоме фосфора и кратной связи активированного алкена. Так, менее кислый диизопропилфосфит уступает по реакционной способности диметил- и диэтилфосфитам. В случае бис(2-этилгексил)фосфита, содержащего длинные алкоксильные заместители у атома фосфора, снижения реакционной способности не наблюдалось. Это указывает на то, что на протекание реакции большее влияние оказывает кислотность Р-Н протона, чем стерический эффект заместителей при атоме фосфора. Предложенный подход может применяться для синтеза диметил-3-амино-3-оксипропилфосфоната, прекурсора антипирена Pyrovatex CP.

При использовании этилового эфира бенzilпропиоловой кислоты в качестве субстрата в присутствии трибутилфосфина был получен